

(19) HU

MAGYAR  
NÉPKÖZTÁRSASÁGORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATALSZABADALMI  
LEÍRÁS

B

A bejelentés napja: (22) 1983. 06. 30.

(21) 2382/83

A bejelentés elsőbbsége: (33) (32) (31)  
DE: 82. 07. 01. (P 32 24 512.2)

A közzététel napja: (41) (42) 1984. 04. 30.

Megjelent: (45) 1988. XI. 30.

Nemzetközi  
osztályjelzet:(51) NSZO,  
C 07 D 471/04  
C 07 D 235/18  
C 07 D 473/00  
A 61 K 31/415

Feltalálók: (72)

dr. HAUER Norbert, dr. AUSTEL Volkhard, dr. REIFFEN Manfred,  
dr. DIEDEREN Willi, Biberach, dr. HEIDER Joachim, Warthausen,  
DE

Szabadalmas: (73)

dr. Karl Thomae GmbH., Biberach an der Riss, DE

(54)

## ELJÁRÁS ÚJ IMIDAZOL-SZÁRMAZÉKOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

## (57) KIVONAT

A találmány az (I) általános képletű új imidazol-származékoknak, ezek tautomerjeinek és savaddíciós sóinak előállítására vonatkozik; a képletben

A és B a közöttük levő két szénatommal együtt (a), (b), (c) vagy (d) képletű csoportot jelent; a csoportokban

$R_4$  hidrogén- vagy halogénatomot, alkil-, hidroxi-, alkoxi-, trifluor-metil-, ciano-, alkoxi-karbonil-, amino-karbonil-, alkil-amino-karbonil-, hidroxi-alkil-, nitro-, amino-, alkanoil-amino-, alkoxi-karbonil-amino-, amino-karbonil-amino-, alkil-amino-karbonil-amino-, alkán-szulfonil-aminocsoportot,

$R_5$  hidrogén- vagy halogénatomot, alkil- vagy alkoxycsoportot, és

$R_6$  hidrogén- vagy halogénatomot vagy alkilcsoportot,

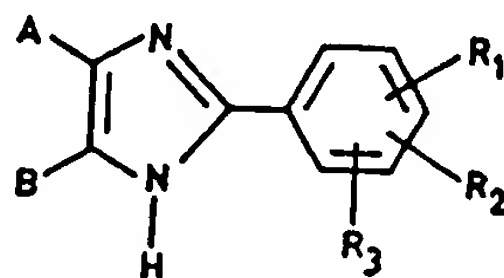
$R_1$  alkánszulfonil-oxi-, trifluor-metánszulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, trifluor-metánszulfonil-amino-, N-alkil-trifluor-metánszulfonil-amino-, alkil-szulfenil-metil-, alkil-szulfonil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot, alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot, továbbá amino-, alkil-amino-, vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot, ha A és B (a), (b) vagy (d) csoport, nitro- vagy ciáncsoportot is,

$R_2$  alkil-, alkoxi- vagy dialkil-aminocsoportot és

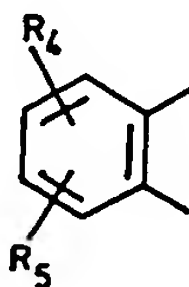
$R_3$  hidrogénatomot vagy alkoxycsoportot jelent.

A fentiekben a helyettesítőkben lévő alkilcsoportok 1-2, 1-3, ill. 1-4 szénatomosak.

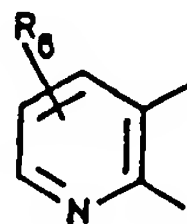
Az (I) általános képletű imidazol-származékokat hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények különböző eredetű szívelégtelenségek kezelésére alkalmasak.



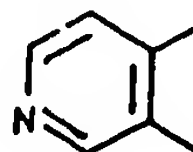
(I)



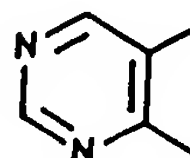
(a)



(b)



(c)



(d)

tóanyagot, a glicerint és a szacharin-nátriumot vízben oldva adjuk hozzá. Az oldatot végül tisztára szűrjük.

### Szabadalmi igénypontok

1. Eljárás az (I) általános képletű imidazol-származékok – a képletben

A és B a közöttük levő két szénatommal együtt (a) vagy (b) általános képletű vagy (c) vagy (d) képletű csoportot jelent; a képletekben

$R_4$  hidrogén- vagy halogénatomot, alkil-, hidrox-, alkoxi-, trifluor-metil-, ciano-, alkoxi-karbonil-, amino-karbonil-, alkil-amino-karbonil, hidrox-alkil-, nitro-, amino-, alkanoil-amino-, alkoxi-karbonil-amino-, amino-karbonil-amino-, alkil-amino-karbonil-amino- vagy alkánszulfonil-amino-csoportot jelent;

$R_5$  hidrogén- vagy halogénatomot, alkil- vagy alkoxycsoportot jelent és

$R_6$  hidrogén- vagy halogénatomot vagy alkilcsoportot jelent, és az előzőekben említett alkilcsoportok 1–3 szénatomosak;

$R_1$  alkánszulfonil-oxi-, trifluor-metánszulfonil-oxi-, alkán-szulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, trifluor-metánszulfonil-amino-, N-alkil-trifluor-metánszulfonil-amino-, alkil-szulfenil-metil-, alkil-szulfenil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot jelent; alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot jelent, amelyben megnevezett csoportok alkilrésze 1–3 szénatomos; továbbá amino-, dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot jelent, és a helyettesítőben az alkilcsoport 1–2 szénatomos, továbbá 1–4 szénatomos alkil-amino-szulfonil-csoportot, és ha A és B (a) vagy (b) általános képletű csoport vagy (d) képletű csoport, nitro- vagy cianocsoportot is jelent;

$R_2$  1–3 szénatomos alkilcsoportot, az alkilrészen 1–2 szénatomos alkoxi- vagy dialkil-aminocsoportot és

$R_3$  hidrogénatomot vagy 1–3 szénatomos alkoxycsoportot jelent, tautomerjeik és savaddíciós sóik – különösen szervetlen vagy szerves savakkal képzett, fiziológiailag elviselhető savaddíciós sóik – előállítására *azzal jellemezve*, hogy

a) adott esetben a reakcióelegyben képzett, valamely (II) általános képletű vegyületet – a képletben

A és B jelentése a tárgyi körben megadott, az X vagy Y jelképek közül az egyik hidrogénatomot jelent és a másik vagy az X és az Y jelképek mindegyike (i) általános képletű csoportot jelent, a képletben

$R_1$ ,  $R_2$  és  $R_3$  jelentése a tárgyi körben megadott,

$Z_1$  és  $Z_2$  azonosak vagy egymástól eltérőek lehetnek, és adott esetben szubsztituált aminocsoportokat vagy adott esetben kis szénatomszámú alkilcsoportokkal szubsztituált hidrox- vagy merkaptocsoportokat jelentenek vagy  $Z_1$  és  $Z_2$  együtt egy oxigén- vagy kénatomot, adott esetben 1–3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált iminocsoportot, 2–3 szénatomos alkilén-dioxi- vagy alkilén-ditio-csoportot jelent – gyűrűzésének vetünk alá, vagy

b) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében  $R_1$  alkil-szulfenil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot jelent, A, B,  $R_2$  és  $R_3$  a tárgyi körben megadott, egy az a) eljárás szerint kapott (III) általános képletű vegyületet oxidálunk – a képletben

A, B,  $R_2$  és  $R_3$  jelentése a tárgyi körben megadott és  $R_1$  olyan alkil-szulfenil-metil- vagy alkil-szulfenil-metilcsoportot jelent, amelyben az alkilrész 1–3 szénatomos – vagy

c) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében  $R_1$  alkánszulfonil-oxi-, trifluor-metán-szulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, trifluor-metánszulfonil-amino- vagy N-alkil-trifluor-metánszulfonil-aminocsoportot és/vagy  $R_4$  alkánszulfonil-aminocsoportot jelent, A, B,  $R_2$  és  $R_3$  tárgyi körben megadott, egy (IV) általános képletű vegyületet – a képletben A, B,  $R_2$  és  $R_3$  jelentése a tárgyi körben megadott és  $R_1$  hidrox-, aminocsoportot vagy olyan N-alkil-aminocsoportot jelent, amelynek alkilrésze 1–3 szénatomos és/vagy  $R_4$  jelentése aminocsoport – egy (V) általános képletű szulfonsavval vagy reakcióképes származékával reagáltatjuk – a képletben  $R_1$  1–3 szénatomos alkilcsoportot vagy trifluor-metilcsoportot jelent – vízelvonó és/vagy a savat vagy az amint aktiváló szer jelenlétében vagy

d) Olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében A, B,  $R_2$  és  $R_3$  a tárgyi körben megadott,  $R_1$  amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot vagy amino-, dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot vagy alkil-amino-szulfonilcsoportot és/vagy  $R_4$  amino-karbonil- vagy alkil-amino-karbonil-csoportot jelent, egy (VI) általános képletű vegyületet – amely képletben  $R_2$ ,  $R_3$ , A és B jelentése a tárgyi körben megadott és  $R_1$  karboxil- vagy hidrox-szulfonil-csoportot és/vagy  $R_4$  karboxilcsoportot jelent – vagy valamely reakcióképes származékát vízelvonó vagy a savat aktiváló szer jelenlétében egy (VII) általános képletű aminnal – a képletben  $R_8$  és  $R_9$  azonosak vagy egymástól eltérőek lehetnek, és hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelentenek vagy együtt morfolingyűrűt alkotnak – vagy valamely reakcióképes származékával reagáltatjuk, majd kívánt esetben az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében  $R_1$  és/vagy  $R_4$  cianocsoportot jelent a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_1$  és/vagy  $R_4$  összesen 2–4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot, vagy amino-karbonilcsoportot jelent és/vagy

az olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében  $R_4$  és/vagy  $R_1$  helyén karboxycsoport van, észterezéssel a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_4$  összesen 2–4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot jelent és/vagy  $R_1$  2–4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében  $R_4$  alkanoil-aminocsoportot jelent, hidrolízissel a megfelelő olyan (I)

általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_4$  aminocsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyület, amelynek képletében  $R_4$  nitrocsoportot jelent, redukcióval a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_4$  aminocsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyület, amelynek képletében  $R_4$  aminocsoportot jelent, diazóniumsóvá való átalakítással és az ezt követő melegítéssel a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_4$  hidroxicsoprotot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyület, amelynek képletében  $R_4$  aminocsoportot jelent, karbamoilezéssel a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_4$  amino-karbonil-amino- vagy alkil-amino-karbonil-amincsoportot jelent és/vagy

az így kapott olyan (I) általános képletű vegyület, amelynek képletében  $R_4$  alkoxi-karbonilcsoportot jelent, amidálással a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_4$  amino-karbonil- vagy alkil-amino-karbonilcsoportot jelent és/vagy az így kapott olyan (I) általános képletű vegyület, amelynek képletében  $R_4$  alkoxi-karbonilcsoportot jelent, redukcióval a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_4$  hidroximetilcsoportot jelent és/vagy

az így kapott (I) általános képletű vegyületet savaddíciós sójává, elsősorban szerves savakkal képzett, fiziológiailag elviselhető savaddíciós sójává alakítjuk. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

2. Eljárás az (I') általános képletű imidazol-származékok – a képletben

$A_1$  és  $B_1$  közöttük levő két szénatommal együtt (g) vagy (d) képletű vagy (j) általános képletű csoportot jelent; utóbbi képletben  $R_{4a}$  hidrogén- vagy halogénatomot, trifluor-metil-, ciano- vagy 1–3 szénatomos alkoxicsoprotot jelent,

$R_{1a}$  alkánszulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, alkil-szulfenil-metil-, alkil-szulfonil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot jelent, és a csoportokban az alkilrész 1–3 szénatomos; továbbá alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot jelent, és az alkilrész 1–3 szénatomos; továbbá amino-, az alkilrészben 1–2 szénatomos dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot jelent, továbbá 1–4 szénatomos alkil-amino-szulfonil-, nitro- vagy cianocsoportot jelent,

$R_{2a}$  1–2 szénatomos alkoxi- vagy az alkilrészben 1–2 szénatomos dialkil-aminocsoportot és

$R_{3a}$  hidrogénatomot vagy 1–3 szénatomos alkoxicsoprotot jelent –

tautomerjeik és savaddíciós sóik, elsősorban szerves savakkal képzett, fiziológiailag elviselhető savaddíciós sóik előállítására, azzal lemezve, hogy

a) adott esetben a reakcióelegyben képzett, valamely (IIa) általános képletű vegyületet – a képletben

$A_1$  és  $B_1$  jelentése a tárgyi körben megadott,  $X_1$  és  $Y_1$  jelképek közül az egyik hidrogénatomot jelent és a másik vagy az  $X_1$  és az  $Y_1$  jelképek mindegyike (k) általános képletű csoportot jelent, a képletben  $R_{1a}$ – $R_{3a}$  jelentése a tárgyi körben megadott,

$Z_{1a}$  és  $Z_{2a}$ , amelyek egymással egyezők vagy egymástól eltérők lehetnek, adott esetben szubsztituált aminocsoportokat vagy adott esetben kis szénatomszámú alkilcsoportokkal szubsztituált hidroxil- vagy merkaptocsoportokat jelentenek vagy  $Z_{1a}$  és  $Z_{2a}$  együtt egy oxigén- vagy kénatomot, adott esetben 1–3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált iminocsoportot, 2–3 szénatomos alkilén-dioxi- vagy alkilén-ditiocsoportot jelent – gyűrűzárással vetünk alá, vagy

b) olyan (I') általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében  $R_{1a}$  alkil-szulfonil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot jelent,  $A_1$ ,  $B_1$ ,  $R_{2a}$  és  $R_{3a}$  a fenti, egy az a) eljárás szerint kapott (IIa) általános képletű vegyületet oxidálunk – a képletben  $A_1$ ,  $B_1$ ,  $R_{2a}$  és  $R_{3a}$  jelentése a tárgyi körben megadott és

$R_{1a}$  olyan alkil-szulfenil-metil- vagy alkil-szulfonil-metil-csoportot jelent, amelyben az alkilrész 1–3 szénatomos –, vagy

c) olyan (I') általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében  $R_{1a}$  alkánszulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino- vagy N-alkil-alkánszulfonil-aminocsoportot jelent,  $A_1$ ,  $B_1$ ,  $R_{2a}$  és  $R_{3a}$  a tárgyi körben megadott, egy (IVa) általános képletű vegyületet – a képletben  $A_1$ ,  $B_1$ ,  $R_{2a}$  és  $R_{3a}$  jelentése a tárgyi körben megadott és  $R''_{1a}$  hidroxil-, amino- vagy olyan N-alkil-aminocsoportot jelent, amelynek alkilrésze 1–3 szénatomos – egy (Va) általános képletű szulfonsavval vagy reakcióképes származékával reagáltatjuk – amely képletben  $R_{7a}$  1–3 szénatomos alkilcsoportot jelent – vízelvonószer és/vagy a savat vagy az amint aktiváló szer jelenlétében vagy

d) olyan (I') általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében  $R_{1a}$  amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot vagy amino-, dialkil-amino- vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot vagy alkil-amino-szulfonil-csoportot jelent,  $A_1$ ,  $B_1$ ,  $R_{2a}$  és  $R_{3a}$  a tárgyi körben megadott, egy (VIa) általános képletű vegyületet – a képletben  $A_1$ ,  $B_1$ ,  $R_{2a}$  és  $R_{3a}$  jelentése a tárgyi körben megadott és  $R'''_{1a}$  karboxil- vagy hidroxil-szulfonilcsoportot jelent – vagy reakcióképes származékát vízelvonó- vagy a savat aktiváló szer jelenlétében egy (VIIa) általános képletű aminnal – a képletben  $R_{8a}$  és  $R_{9a}$  azonosak vagy egymástól eltérők lehetnek, hidrogénatomokat vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportokat jelentenek vagy együtt morfolinogyűrűt alkotnak – vagy reakcióképes származékával reagáltatjuk, majd kívánt esetben az így kapott olyan (I') általános képletű vegyületet, amelynek képletében  $R_{1a}$  cianocsoportot jelent, olyan (Ia) általános képletű vegyületté alakítjuk, amelynek képletében  $R_{1a}$  összesen 2–4 szénatomos alkoxi-karbonilcsoportot jelent és/vagy az így kapott (I') általános képletű vegyületet savaddíciós sójává, különösen szervesen



vagy szerves savakkal képzett, fiziológiailag elviselhető savaddíciós sójává alakítjuk. (Elsőbbsége: 1982. 07. 01.)

3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti bármely eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót oldószerben hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

4. Az 1. igénypont szerinti a) eljárás, a 2. igénypont szerinti a) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót 0 °C és 250 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

5. Az 1. igénypont szerinti a) eljárás, a 2. igénypont szerinti a) eljárás *azzal jellemezve*, hogy a gyűrűzárást a reakcióelegy forráspontján hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

6. Az 1. igénypont szerinti a) eljárás, a 2. igénypont szerinti a) eljárás, a 3., 4. vagy 5. igénypontok szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a gyűrűzárást valamely kondenzálószer vagy bázis jelenlétében hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

7. Az 1. igénypont szerinti b) eljárás, a 2. igénypont szerinti b) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót – 80 °C és 100 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

8. Az 1. igénypont szerinti c) eljárás, a 2. igénypont szerint c) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót 0 °C és

100 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

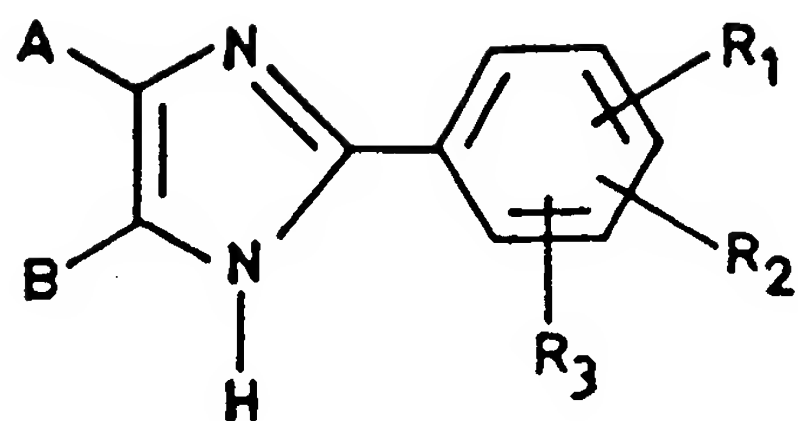
9. Az 1. igénypont szerinti d) eljárás, a 2. igénypont szerinti d) eljárás vagy a 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy a reakciót – 25 °C és 250 °C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

10. Eljárás egy vagy több (I) általános képletű imidazol-származékot vagy fiziológiailag elviselhető savaddíciós sóját – a képletben A, B; R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> és R<sub>3</sub> jelentése az 1. igénypont tárgyi körében megadott – hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására *azzal jellemezve*, hogy az 1. igénypont szerinti bármelyik eljárással előállított hatóanyagot a gyógyszerkészítményekben szokásos hordozó-, hígító-, töltő- és/vagy egyéb segédanyaggal együtt kikészítjük. (Elsőbbsége: 1983. 06. 30.)

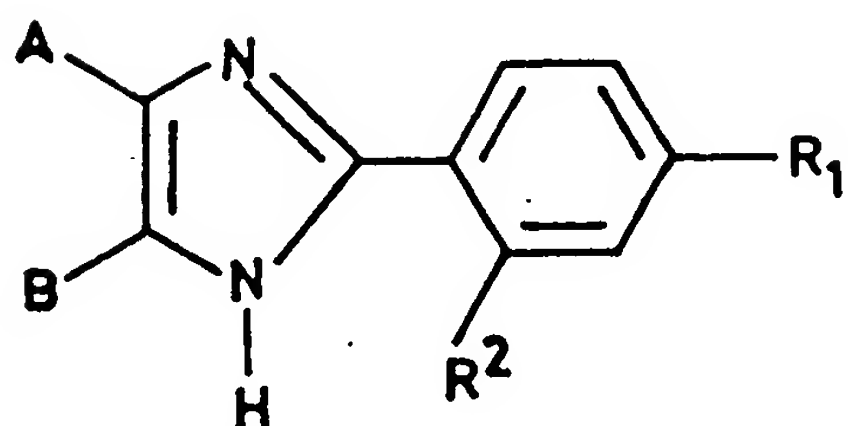
11. Eljárás egy vagy több (I') általános képletű imidazol-származékot vagy fiziológiailag elviselhető savaddíciós sóját – a képletben A<sub>1</sub>, B<sub>1</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>21</sub> és R<sub>31</sub> jelentése a 2. igénypont tárgyi körében megadott – hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására *azzal jellemezve*, hogy a 2. igénypont szerinti bármelyik eljárással előállított hatóanyagot a gyógyszerkészítményekben szokásos hordozó-, hígító-, töltő- és/vagy egyéb segédanyaggal együtt kikészítjük. (Elsőbbsége: 1982. 07. 01.)

4 oldal rajz

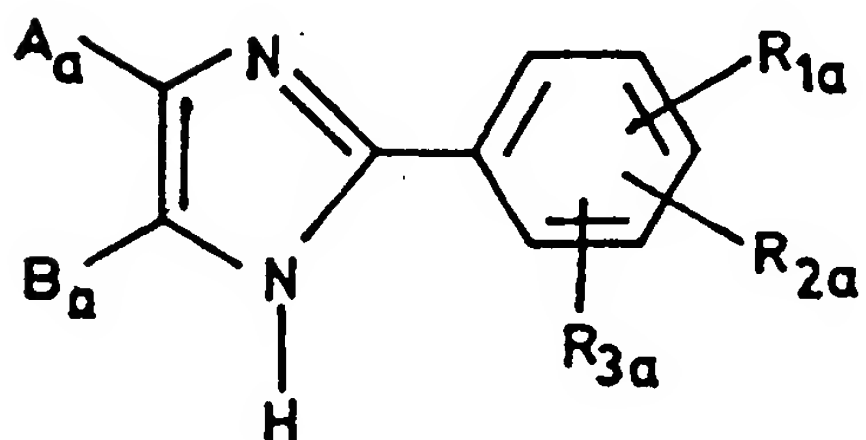
NSZO<sub>4</sub>: C 07 D 471/04  
 C 07 D 235/18  
 C 07 D 473/00  
 A 61 K 31/415



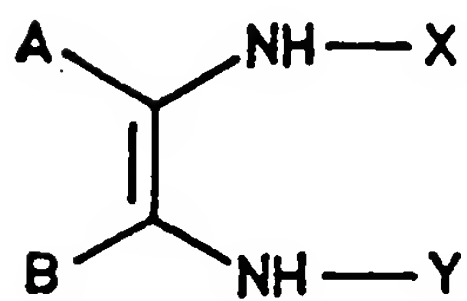
(I)



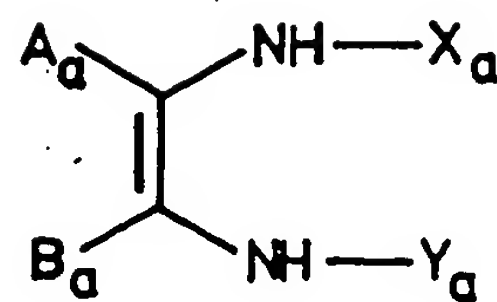
(Ia)



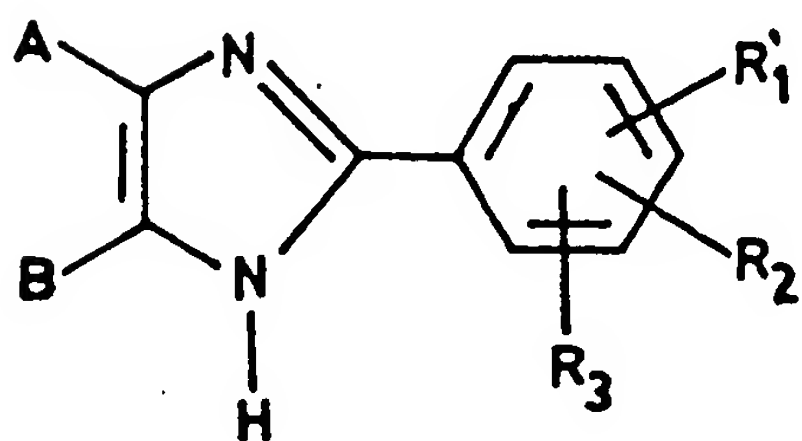
(I')



(II)

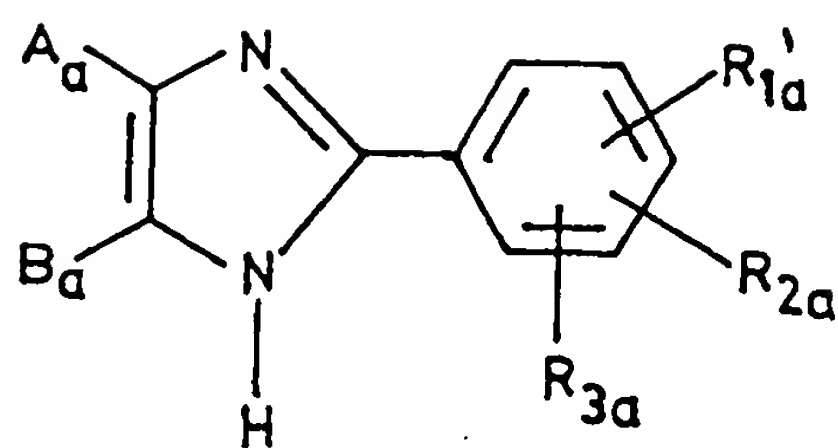


(IIa)

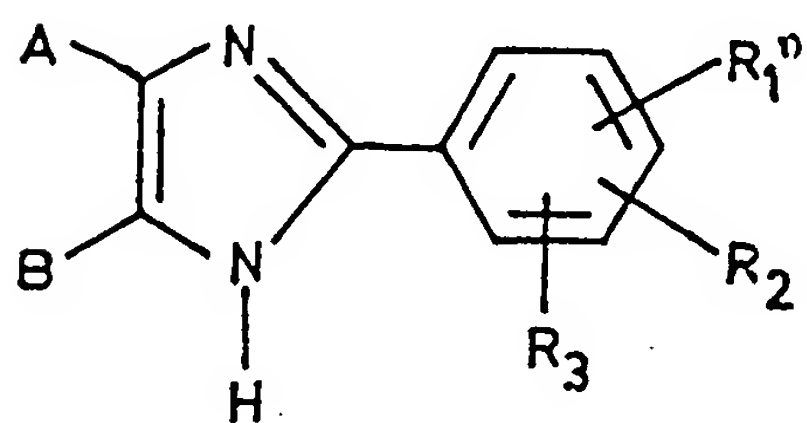


(III)

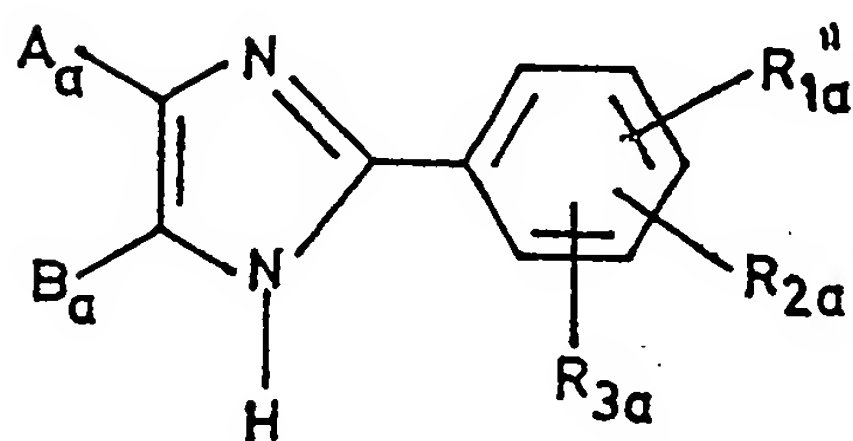
NSZO<sub>4</sub>: C 07 D 471/04  
 C 07 D 235/18  
 C 07 D 473/00  
 A 61 K 31/415



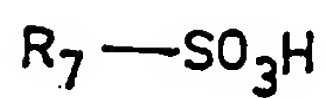
(III a)



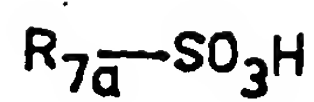
(IV)



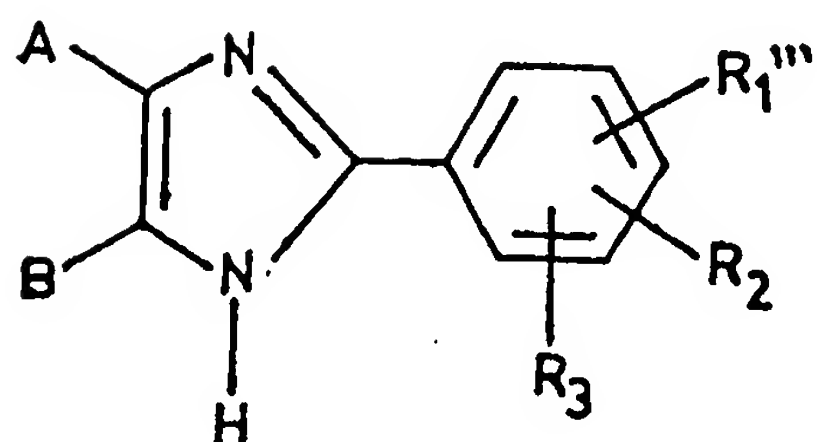
(IV a)



(V)

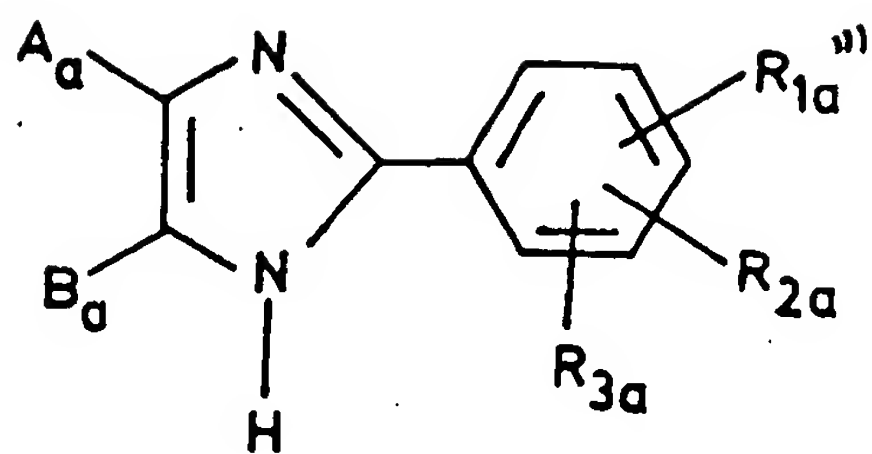


(Va)

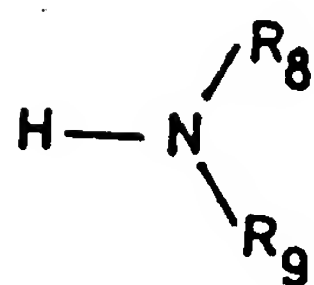


(VI)

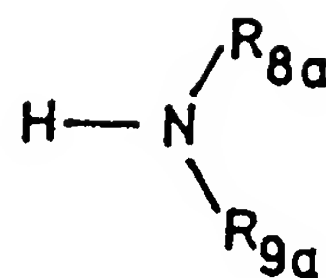
NSZO<sub>4</sub>: C 07 D 471/04  
C 07 D 235/18  
C 07 D 473/00  
A 61 K 31/415



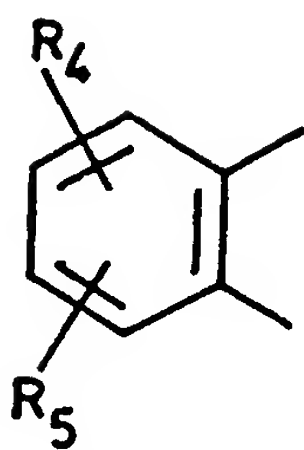
(VI a)



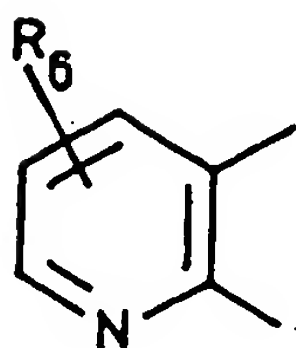
(VII)



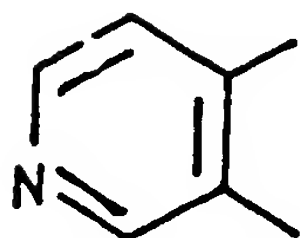
(VII a)



(a)



(b)



(c)

## ABSTRACT

## Process for preparing new imidazole derivatives

The invention relates to a process for preparing new imidazole derivatives of formula //, further tautomers and acid addition salts thereof resp.; in the formula

A and B with the two carbon atoms mean one of the groups (a)-(d); in such groups R4 stands for a hydrogen or halogen atom, an alkyl, -OH, alkoxy, trifluor-methyl, -CN, alkoxy-carbonyl, amino-carbonyl, alkyl-amino-carbonyl, HO-alkyl, nitro, amino, alkanoyl-amino, alkoxy-carbonyl-amino, amino-carbonyl-amino, alkyl-amino-carbonyl-amino, alkansulphonyl-amino group,

R5 means a hydrogen or halogen atom, an alkyl or alkoxy group and

R6 means a hydrogen or halogen atom or an alkyl group,

R1 stands for an alkansulphonyl-oxy, trifluor-methansulphonyl-oxy, alkansulphonyl-amino, N-alkyl-alkansulphonyl-amino, trifluor-methansulphonyl-amino, N-alkyl-trifluor-methansulphonyl-amino, alkyl-sulphenyl-methyl, alkyl-sulphinyl-methyl or alkyl-sulphonyl-methyl; a carbonyl group substituted with an alkoxy, amino, alkyl-amino or dialkyl-amino group, a sulphonyl group substituted with an amino, alkyl-amino or morpholino group, and if A and B mean (a), (b) or (d) group, R1 stands also for a nitro or cyano group,

R2 means an alkoxy-, alkyl- or dialkyl-amino group, and

R3 means a hydrogen atom or an alkoxy group.

The alkyl groups present as substituents in the above groups contain 1-2, 1-3 and 1-4 carbon atoms.

The pharmaceutical compositions containing the imidazole derivatives of formula // as active ingredients may be used for the treatment of heart failures of different origin.



Rekord - (PN=(192152))/szabadal - PIPACS

1. oldal, összesen: 2

**Érvénytelen**

Ügyszám: P8302382

**Közzétételi szám: 31210**

**Lajstromszám: 192152**

**Bejelenés napja: 1983.06.30**

+ 88. VII. 1. en. illeték

**Megadás meghirdetése: 1987.05.28**

Unió elsőbbség: DE3224512 - 1982.07.01

NSZO: C07D-471/04; C07D-235/18; C07D-473/00; A61K-031/415

**Cím:** Eljárás új imidazol-származékok előállítására

Angol cím: PROCESS FOR PREPARING NEW IMIDAZOLE DERIVATIVES

**Jogosult:** Dr. Karl Thomae GmbH., Biberach an der Riss, DE

Feltaláló: dr. Haucl, Norbert, Biberach/Riss, DE

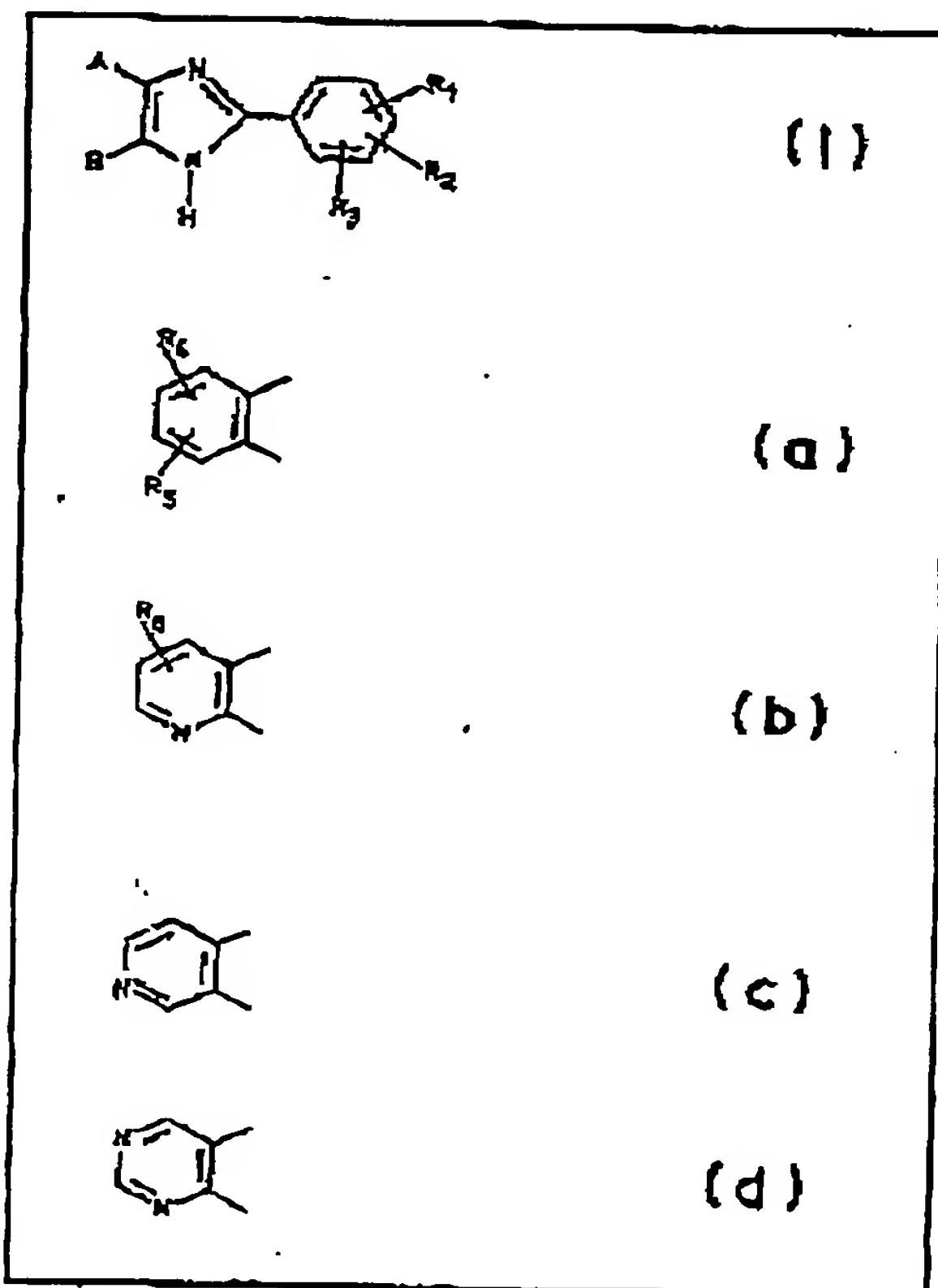
dr. Austel, Volkhard, Biberach/Riss, DE

dr. Diederer, Willi, Biberach/Riss, DE

dr. Reiffen, Manfred, Biberach/Riss, DE

dr. Heider, Joachim, Oberhöfen-Warthausen, DE

Képviselő: BNÜMK, Budapest



***Kivonat (közzétételi):***

Rekord - (PN=(192152))/szabadal - PIPACS

2. oldal, összesen: 2

A találmány az (I) általános képletű új imidazolszármazékoknak, ezek tautomerjeinek és savaddíciós sóinak előállítására vonatkozik; a képletben

A és B a közöttük levő két szénatommal együtt (a), (b), (c) vagy (d) képletű csoportot jelent; a csoportokban

R4 hidrogén- vagy halogénatomot, alkil-, hidroxil-, alkoxi-, trifluor-metil-, ciano-, alkoxi-karbonil-, amino-karbonil-, alkil-amino-karbonil-, hidroxil-alkil-, nitro-, amino-, alkanoil-amino-, alkoxi-karbonil-amino-, amino-karbonil-amino-, alkil-amino-karbonil-amino-, alkán-szulfonil-aminocsoportot,

R5 hidrogén- vagy halogénatomot, alkil- vagy alkoxycsoportot, és

R6 hidrogén- vagy halogénatomot vagy alkilcsoportot,

R1 alkánszulfonil-oxi-, trifluor-metánszulfonil-oxi-, alkánszulfonil-amino-, N-alkil-alkánszulfonil-amino-, trifluor-metánszulfonil-amino-, N-alkil-trifluor-metánszulfonil-amino-, alkil-szulfenil-metil-, alkil-szulfonil-metil- vagy alkil-szulfonil-metilcsoportot, alkoxi-, amino-, alkil-amino- vagy dialkil-aminocsoporttal szubsztituált karbonilcsoportot, továbbá amino-, alkil-amino-, vagy morfolinocsoporttal szubsztituált szulfonilcsoportot, ha A és B (a), (b) vagy (d) csoport, nitro- vagy ciáncsoportot is,

R2 alkil-, alkoxi- vagy dialkil-aminocsoportot és

R3 hidrogénatomot vagy alkoxycsoportot jelent.

A fentiekben a helyettesítőkben lévő alkilcsoportok 1-2, 1-3, ill. 1-4 szénatomosak.

Az (I) általános képletű imidazol-származékokat hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények különböző eredetű szívelégtelenségek kezelésére alkalmasak.